

3-3-05

518914

PCT/JP2003/007950

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Translation

Applicant's or agent's file reference 3059WO0P	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/JP2003/007950	International filing date (day/month/year) 24 June 2003 (24.06.2003)	Priority date (day/month/year) 25 June 2002 (25.06.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 47/30, 47/34, 47/12, 47/02, 47/06, 9/52, 9/50, 9/14, 38/04, 45/00, A61P 15/00, 43/00		
Applicant TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.		

<p>1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>10</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p><input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).</p> <p>These annexes consist of a total of <u> </u> sheets.</p>	
<p>3. This report contains indications relating to the following items:</p> <p>I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report</p> <p>II <input type="checkbox"/> Priority</p> <p>III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p>IV <input checked="" type="checkbox"/> Lack of unity of invention</p> <p>V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p>VI <input checked="" type="checkbox"/> Certain documents cited</p> <p>VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application</p> <p>VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application</p>	

Date of submission of the demand 24 July 2003 (24.07.2003)	Date of completion of this report 07 April 2004 (07.04.2004)
Name and mailing address of the IPEA/JP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/007950

I. Basis of the report

1. With regard to the elements of the international application:*

- ☒ the international application as originally filed
- ☐ the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the claims:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, as amended (together with any statement under Article 19
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the drawings:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____
- ☐ the sequence listing part of the description:
 pages _____, as originally filed
 pages _____, filed with the demand
 pages _____, filed with the letter of _____

2. With regard to the language, all the elements marked above were available or furnished to this Authority in the language in which the international application was filed, unless otherwise indicated under this item. These elements were available or furnished to this Authority in the following language _____ which is:

- ☐ the language of a translation furnished for the purposes of international search (under Rule 23.1(b)).
- ☐ the language of publication of the international application (under Rule 48.3(b)).
- ☐ the language of the translation furnished for the purposes of international preliminary examination (under Rule 55.2 and/or 55.3).

3. With regard to any nucleotide and/or amino acid sequence disclosed in the international application, the international preliminary examination was carried out on the basis of the sequence listing:

- ☐ contained in the international application in written form.
- ☐ filed together with the international application in computer readable form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in written form.
- ☐ furnished subsequently to this Authority in computer readable form.
- ☐ The statement that the subsequently furnished written sequence listing does not go beyond the disclosure in the international application as filed has been furnished.
- ☐ The statement that the information recorded in computer readable form is identical to the written sequence listing has been furnished.

4. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

5. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).**

* Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report since they do not contain amendments (Rule 70.16 and 70.17).

** Any replacement sheet containing such amendments must be referred to under item 1 and annexed to this report.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/007950

IV. Lack of unity of invention

1. In response to the invitation to restrict or pay additional fees the applicant has:

- ☐ restricted the claims.
- ☐ paid additional fees.
- ☐ paid additional fees under protest.
- ☒ neither restricted nor paid additional fees.

2. ☐ This Authority found that the requirement of unity of invention is not complied with and chose, according to Rule 68.1, not to invite the applicant to restrict or pay additional fees.

3. This Authority considers that the requirement of unity of invention in accordance with Rules 13.1, 13.2 and 13.3 is

- ☐ complied with.
- ☒ not complied with for the following reasons:

SEE SUPPLEMENTAL SHEET

4. Consequently, the following parts of the international application were the subject of international preliminary examination in establishing this report:

- ☒ all parts.
- ☐ the parts relating to claims Nos. _____

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

Claims 1-36 include at least the following special technical features:

a physiologically active substance;
an acid or a base; and
a biodegradable polymer.

However, claim 37 does not include a special technical feature pertaining to a solution that comprises a biodegradable polymer.

Preparations corresponding to sustained-release preparations which are configured from a physiologically active substance and an aqueous solution comprising an amount of acid that is at least approximately 1.5 times the amount of the physiologically active substance in terms of moles are well known as disclosed in, for example, the following documents cited in the international search report:

- EP 505966 A1 (Hoechst AG), 30 September 1992, entire document, especially claims 1, 4 and 5(d); page 2, line 51; and Beispiel 1, & AU 9213109 B & JP 5-70363 A;
- WO 01/5379 A1 (Samyang Corp.), 25 January 2001, entire document, especially examples 22 and 27, & AU 2000/60247 B & EP 1196149 A1 & JP 2003-504393 A & US 6599519 A;
- JP 2000-143533 A (Asahi Chemical Ind. Co., Ltd.), 23 May 2000, entire document, especially example 1 and reference example 5, (Family: none);
- WO 93/24150 A1 (Zeneca Ltd.), 09 December 1993, entire document, especially page 3, lines 29-30 and example 1, & FR 2691631 A1 & AU 9340847 B & GB 2282066 A & JP 8-501064 A & US 5889110 A & US 6034175 A & US 2002/198315 A; and

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

- JP 11-116499 A (Asahi Chemical Ind. Co., Ltd.), 27 April 1999, entire document, especially page 2, column 2, paragraph [0006]; examples 1 and 4; and reference example 3, (Family: none);

therefore, claims 1-36 and claim 37 cannot be said to have a special technical feature in common.

Consequently, the inventions that are set forth in claims 1-37 cannot be considered to be so linked as to form a single general inventive concept.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

 International Application No.
 PCT/JP 03/07950

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	8	YES
	Claims	1-7, 9-37	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-37	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-37	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

Document 1: WO 93/24150 A1 (Zeneca Ltd.), 09 December 1993, entire document, especially page 3, lines 29-30 and example 1, & FR 2691631 A1 & AU 9340847 B & GB 2282066 A & JP 8-501064 A & US 5889110 A & US 6034175 A & US 2002/198315 A

Document 2: EP 505966 A1 (Hoechst AG), 30 September 1992, entire document, especially claims 1, 4 and 5(d); page 2, line 51; and Beispiel 1, & AU 9213109 B & JP 5-70363 A

Document 3: WO 01/5379 A1 (Samyang Corp.), 25 January 2001, entire document, especially examples 22 and 27, & AU 2000/60247 B & EP 1196149 A1 & JP 2003-504393 A & US 6599519 A

Document 4: EP 761213 A2 (Takeda Chem. Ind., Ltd.), 12 March 1997, entire document, especially page 10, lines 23-25 and example 1, & CA 2184654 A1 & JP 9-132524 A & US 6045830 A

Document 5: EP 586238 A2 (Takeda Chem. Ind., Ltd.), 09 March 1994, entire document, especially page 5, lines 49-51 and reference examples 5, 7 and 9, & CA 2105374 A1 & JP 6-192068 A & US 5575987 A & US 5716640 A

Document 6: EP 781548 A2 (Takeda Chem. Ind., Ltd.), 02

- July 1997, entire document, especially the examples, & CA 2192773 A1 & JP 9-221417 A
- Document 7: EP 839525 A1 (Takeda Chem. Ind., Ltd.), 06 May 1998, entire document, especially page 10, lines 25-33 and the examples, & CA 2219698 A1 & JP 10-82496 A & US 6113943 A
- Document 8: WO 01/83594 A1 (Tanabe Seiyaku Co.), 08 November 2001, entire document, especially claim 7; page 21, lines 10-14; and example 13; & AU 2001/52588 B & EP 1277787 A1
- Document 9: WO 00/40259 A1 (Dong Kook Pharm. Co., Ltd.), 13 July 2000, & JP 2002-534392 A
- Document 10: WO 00/33809 A1 (Mediolanum Farm Spa), 15 June 2000, & AU 2000/19711 B & EP 1137400 A1 & JP 2002-531486 A
- Document 11: EP 779072 A1 (Takeda Chem. Ind., Ltd.), 18 June 1997, & CA 2192782 A1 & JP 9-221418 A & US 5851451 A & US 6036976 A & JP 2001-252552 A

(The abovementioned documents are all cited in the international search report.)

(1)

The inventions that are set forth in claims 1-7 and 9-37 are disclosed in document 1; therefore, they lack novelty and do not involve an inventive step.

In addition, document 1 indicates that it is possible to use leuporelin as the physiologically active component; therefore, claim 8 does not involve an inventive step in the light of document 1.

(1-2)

Documents 2 and 3 disclose medicinal compositions that exhibit a heightened sustained-release

characteristic, endurance characteristic and the like, which are obtained by mixing a physiologically active substance such as a peptide or a protein with a biodegradable polymer and a solution comprising an amount of an acetic acid component (acetic acid or glacial acetic acid) that is considered to be at least approximately 1.5 times the amount of said physiologically active substance in terms of moles, and then drying the mixture.

Consequently, claims 1-6 and 9-37 lack novelty and do not involve an inventive step in the light of document 2 or document 3.

In addition, documents 2 and 3 indicate that it is possible to use leuprorelin as the physiologically active component; therefore, claims 7 and 8 do not involve an inventive step in the light of document 2 or document 3.

(2)

The technical feature of incorporating an acid such as acetic acid as a pH regulator in order to enhance the stability, solubility or the like of a medicinal component when preparing a medicinal composition wherein the medicinal component is encased within a polymer in order to heighten the sustained-release characteristic or the like of said medicinal component is well known, as disclosed in documents 4-8. In addition, documents 4-8 also indicate that it is possible to use leuprorelin as the medicinal component; therefore, it would be easy for a person skilled in the art to attempt to apply the abovementioned technical feature when preparing a medicinal composition comprising a biodegradable polymer, which is similar to those that are disclosed in documents 4-8, using a LH-RH derivative such as those disclosed in documents 9-11 as a physiologically active component. Furthermore, it is within the scope of the common creative abilities of a person skilled in the art to determine the

amount of acid that is necessary in order to optimize the abovementioned stability, solubility or the like, at that time.

Consequently, claims 1-37 do not involve an inventive step in the light of documents 6-13.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International Application No.

PCT/JP2003/007950

VI. Certain documents cited

1. Certain published documents (Rule 70.10)

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
WO 03/2092 A2 [E, X]	09 January 2003 (09.01.2003)	28 June 2002 (28.06.2002)	29 June 2001 (29.06.2001)
WO 03/2091 A2 [E, X]	09 January 2003 (09.01.2003)	28 June 2002 (28.06.2002)	29 June 2001 (29.06.2001)
WO 03/15820 A1 [E, X]	27 February 2003 (27.02.2003)	08 August 2002 (08.08.2002)	10 August 2001 (10.08.2001)
JP 2003-171264 A [E, X]	17 June 2003 (17.06.2003)	07 December 2001 (07.12.2001)	
WO 03/13609 A1 [E, X]	20 February 2003 (20.02.2003)	01 August 2002 (01.08.2002)	03 August 2001 (03.08.2001)
WO 02/74340 A1 [E, X]	26 September 2002 (26.09.2002)	14 March 2002 (14.03.2002)	06 March 2001 (06.03.2001)
JP 03-252751 A [E, X]	10 September 2003 (10.09.2003)	25 December 2002 (25.12.2002)	26 December 2001 (26.12.2001)

2. Non-written disclosures (Rule 70.9)

Kind of non-written disclosure	Date of non-written disclosure (day/month/year)	Date of written disclosure referring to non-written disclosure (day/month/year)

P C T

国際予備審査報告

(法第12条、法施行規則第56条)
〔PCT36条及びPCT規則70〕

REC'D 22 APR 2004

WIPO

PCT

出願人又は代理人 の書類記号 3059W00P	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/07950	国際出願日 (日.月.年) 24.06.2003	優先日 (日.月.年) 25.06.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl ⁷ A61K47/30, A61K47/34, A61K47/12, A61K47/02, A61K47/06, A61K9/52, A61K9/50, A61K9/14, A61K38/04, A61K45/00, A61P15/00, A61P43/00		
出願人 (氏名又は名称) 武田薬品工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 7 ページからなる。
- ☐ この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。
(PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照)
この附属書類は、全部で ページである。

3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。

- I ☒ 国際予備審査報告の基礎
- II ☐ 優先権
- III ☐ 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成
- IV ☒ 発明の単一性の欠如
- V ☒ PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明
- VI ☒ ある種の引用文献
- VII ☐ 国際出願の不備
- VIII ☐ 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求を受理した日 24.07.2003	国際予備審査報告を作成した日 07.04.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 大久保元浩	4C	8828
電話番号 03-3581-1101 内線 3452			

I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に
 応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。
 PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- ☐ 明細書 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 請求の範囲 第 _____ 項、 出願時に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 PCT19条の規定に基づき補正されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 請求の範囲 第 _____ 項、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 図面 第 _____ ページ/図、 出願時に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 図面 第 _____ ページ/図、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの
- ☐ 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 出願時に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの
 明細書の配列表の部分 第 _____ ページ、 _____ 付の書簡と共に提出されたもの

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である _____ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)という翻訳文の言語
☐ PCT規則48.3(b)という国際公開の言語
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3という翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 _____ ページ
☐ 請求の範囲 第 _____ 項
☐ 図面 図面の第 _____ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

IV. 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☒ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☐ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

(補充欄参照)

4. したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

- ☒ すべての部分
- ☐ 請求の範囲 _____ に関する部分

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)

請求の範囲	8	有
請求の範囲	1-7, 9-37	無

進歩性(IS)

請求の範囲		有
請求の範囲	1-37	無

産業上の利用可能性(IA)

請求の範囲	1-37	有
請求の範囲		無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

- ・文献1: WO 93/24150 A1 (ZENECA LTD) 1993.12.09 文献全体、特にp.3第29-30行、Example 1 & FR 2691631 A1 & AU 9340847 B & GB 2282066 A & JP 8-501064 A & US 5889110 A & US 6034175 A & US 2002/198315 A
- ・文献2: EP 505966 A1 (HOECHST AG) 1992.09.30 文献全体、特にclaim1, 4, 5 (d)、p.2第51行、Beispiel 1 & AU 9213109 B & JP 5-70363 A
- ・文献3: WO 01/5379 A1 (SAMYANG CORP) 2001.01.25 文献全体、特に Example 22, 27 & AU 2000/60247 B & EP 1196149 A1 & JP 2003-504393 A & US 6599 519 A
- ・文献4: EP 761213 A2 (TAKEDA CHEM IND LTD) 1997.03.12 文献全体、特にp.10第23-25行、Example 1 & CA 2184654 A1 & JP 9-132524 A & US 6045830 A
- ・文献5: EP 586238 A2 (TAKEDA CHEM IND LTD) 1994.03.09 文献全体、特にp.5第49-51行、Reference Example 5, 7, 9 & CA 2105374 A1 & JP 6-192068 A & US 5575987 A & US 5716640 A
- ・文献6: EP 781548 A2 (TAKEDA CHEM IND LTD) 1997.07.02 文献全体、特にExamples & CA 2192773 A1 & JP 9-221417 A
- ・文献7: EP 839525 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 1998.05.06 文献全体、特にp.10第25-33行、Examples & CA 2219698 A1 & JP 10-82496 A & US 6113943 A
- ・文献8: WO 01/83594 A1 (TANABE SEIYAKU CO) 2001.11.08 文献全体、特に請求項7、p.21第10-14行、実施例13 & AU 2001/52588 B & EP 1277787 A1
- ・文献9: WO 00/40259 A1 (DONG KOOK PHARM CO LTD) 2000.07.13 & JP 2002-534392 A
- ・文献10: WO 00/33809 A1 (MEDIOLANUM FARM SPA) 2000.06.15 & AU 2000/19711 B & EP 1137400 A1 & JP 2002-531486 A
- ・文献11: EP 779072 A1 (TAKEDA CHEM IND LTD) 1997.06.18 & CA 2192782 A1 & JP 9-221418 A & US 5851451 A & US 6036976 A & JP 2001-252552 A

(上記文献はいずれも国際調査報告で引用されている)

VI. ある種の引用文献

1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/2092 A2 [E, X]	2003. 01. 09	2002. 06. 28	2001. 06. 29
WO 03/2091 A2 [E, X]	2003. 01. 09	2002. 06. 28	2001. 06. 29
WO 03/15820 A1 [E, X]	2003. 02. 27	2002. 08. 08	2001. 08. 10
JP 2003-171264 A [E, X]	2003. 06. 17	2001. 12. 07	
WO 03/13609 A1 [E, X]	2003. 02. 20	2002. 08. 01	2001. 08. 03
WO 02/74340 A1 [E, X]	2002. 09. 26	2002. 03. 14	2001. 03. 06
JP 2003-252751 A [E, X]	2003. 09. 10	2002. 12. 25	2001. 12. 26

2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 IV 欄の続き

請求の範囲 1-36 は、いずれも少なくとも
生理活性物質、
酸または塩基、

及び

生体内分解性ポリマー
を發明特定事項としているのに対し、請求の範囲 37 は、生体内分解性ポリマーの溶
解液が發明特定事項として含まれていない。

そして、生理活性物質及び同物質の約 1.5 倍モル以上の酸を含む水溶液で構成され
る徐放性製剤に相当する製剤は、国際調査報告で挙げられた文献中の例えば

・ EP 505966 A1 (HOECHST AG) 1992.09.30 文献全体、特に claim 1, 4, 5(d)、p. 2 第 5
1 行、

Beispiel 1 & AU 9213109 B & JP 5-70363 A

・ WO 01/5379 A1 (SAMYANG CORP) 2001.01.25 文献全体、特に Example 22, 27 &
AU

2000/60247 B & EP 1196149 A1 & JP 2003-504393 A & US 6599519 A

・ JP 2000-143533 A (旭化成工業株式会社) 2000.05.23 文献全体、特に実施例
1,

参考例 5 (ファミリーなし)

・ WO 93/24150 A1 (ZENECA LTD) 1993.12.09 文献全体、特に p. 3 第 29-30 行、Examp
le 1

& FR 2691631 A1 & AU 9340847 B & GB 2282066 A & JP 8-501064 A & U
S

5889110 A & US 6034175 A & US 2002/198315 A

・ JP 11-116499 A (旭化成工業株式会社) 1999.04.27 文献全体、特に p. 2 第 2 欄【0
006】、

実施例 1, 実施例 4, 参考例 3 (ファミリーなし)

のいずれかに記載されているとおり既知であることから、請求の範囲 1-36 と請求
の範囲 37 は、互いに特別な技術的特徴を共有しているとはいえない。

よって、これらの發明群 1-37 は単一の一般的發明概念を形成するように連関し
ているとは認められない。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V 欄の続き

(1)

(1-1)

請求の範囲 1-7, 9-37 は、文献 1 に記載されているので新規性及び進歩性を有さない。

また、文献 1 には、生理活性成分としてリユープロレリンを採用し得ることも記載されているから、請求の範囲 8 も文献 1 により進歩性を有さない。

(1-2)

文献 2, 3 には、ペプチドもしくはタンパクである生理活性物質に、当該生理活性物質の約 1.5 倍モル以上と認められる酢酸成分（酢酸もしくは氷酢酸）を含有する溶液及び生体内分解性ポリマーを混合し、次いで乾燥せしめてなる、徐放性や持続性等を高めた医薬組成物が記載されている。よって、請求の範囲 1-6, 9-37 は、文献 2 又は文献 3 により新規性及び進歩性を有さない。

また、文献 2, 3 には、生理活性物質としてリユープロレリンを採用し得ることも記載されているから、請求の範囲 7, 8 も文献 2 又は文献 3 により進歩性を有さない。

(2)

薬効成分の徐放性等を高める等のため薬効成分をポリマー内に包含せしめてなる医薬組成物の調製に際し、当該薬効成分の安定性や溶解性等を高めるために pH 調整剤として酢酸等の酸を混合する技術事項は、文献 4-8 に記載されているように周知であるし、しかも文献 4-8 には薬効成分としてリユープロレリンを採用し得ることも記載されていることから、引例 9-11 記載のような、LH-RH 誘導体を生理活性薬理物質として採用する、文献 4-8 と類似の生体内分解性ポリマー含有医薬組成物の調製に際しても、上記技術事項を適用してみることが当業者にとり容易である。またその際、上記安定性や溶解性等を最適とするための酸の量を検討することは、当業者にとり通常なし得る創作能力の發揮に過ぎない。

よって、請求の範囲 1-37 は、いずれも文献 6-13 により進歩性を有さない。